

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

RECEIVED

22 SEP 2004

WIPO



PCT

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 2002/M 208	WEITERES VORGEHEN siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/IPEA/416)	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP 03/03980	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 16.04.2003	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 26.04.2002
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK C07D251/42		
Anmelder BAYER CROPSCIENCE GMBH et al		

- Dieser internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt.
- Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 10 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.
 - ☒ Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT).

Diese Anlagen umfassen insgesamt 1 Blätter.

- Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:
 - I ☒ Grundlage des Bescheids
 - II ☐ Priorität
 - III ☐ Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
 - IV ☒ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
 - V ☒ Begründete Feststellung nach Regel 66.2 a)ii) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
 - VI ☐ Bestimmte angeführte Unterlagen
 - VII ☐ Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
 - VIII ☐ Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags 05.11.2003	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 21.09.2004
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Bevollmächtigter Bediensteter Fritz, M Tel. +49 89 2399-2792 

I. Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der **Bestandteile** der internationalen Anmeldung (*Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt, weil sie keine Änderungen enthalten (Regeln 70.16 und 70.17)*):

Beschreibung, Seiten

1-27 in der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-10, 11 (Teil), 16 (Teil), 17 in der ursprünglich eingereichten Fassung

11 (Teil), 12-15, 16 (Teil) eingegangen am 30.08.2004 mit Schreiben vom 27.08.2004

2. Hinsichtlich der **Sprache**: Alle vorstehend genannten Bestandteile standen der Behörde in der Sprache, in der die internationale Anmeldung eingereicht worden ist, zur Verfügung oder wurden in dieser eingereicht, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.

Die Bestandteile standen der Behörde in der Sprache: zur Verfügung bzw. wurden in dieser Sprache eingereicht; dabei handelt es sich um:

- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist (nach Regel 23.1(b)).
- ☐ die Veröffentlichungssprache der internationalen Anmeldung (nach Regel 48.3(b)).
- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen vorläufigen Prüfung eingereicht worden ist (nach Regel 55.2 und/oder 55.3).

3. Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** ist die internationale vorläufige Prüfung auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das:

- ☐ in der internationalen Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.
- ☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.
- ☐ Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfassten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.

4. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

- ☐ Beschreibung, Seiten:
- ☐ Ansprüche, Nr.:
- ☐ Zeichnungen, Blatt:

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP 03/03980

5. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)).

(Auf Ersatzblätter, die solche Änderungen enthalten, ist unter Punkt 1 hinzuweisen; sie sind diesem Bericht beizufügen.)

6. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

IV. Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung

1. Auf die Aufforderung zur Einschränkung der Ansprüche oder zur Zahlung zusätzlicher Gebühren hat der Anmelder:
- ☐ die Ansprüche eingeschränkt.
 - ☒ zusätzliche Gebühren entrichtet.
 - ☐ zusätzliche Gebühren unter Widerspruch entrichtet.
 - ☐ weder die Ansprüche eingeschränkt noch zusätzliche Gebühren entrichtet.
2. ☐ Die Behörde hat festgestellt, daß das Erfordernis der Einheitlichkeit der Erfindung nicht erfüllt ist, und hat gemäß Regel 68.1 beschlossen, den Anmelder nicht zur Einschränkung der Ansprüche oder zur Zahlung zusätzlicher Gebühren aufzufordern.
3. Die Behörde ist der Auffassung, daß das Erfordernis der Einheitlichkeit der Erfindung nach den Regeln 13.1, 13.2 und 13.3
- ☐ erfüllt ist.
 - ☐ aus folgenden Gründen nicht erfüllt ist:
4. Daher wurde zur Erstellung dieses Berichts eine internationale vorläufige Prüfung für folgende Teile der internationalen Anmeldung durchgeführt:
- ☒ alle Teile.
 - ☐ die Teile, die sich auf die Ansprüche Nr. beziehen.

V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Feststellung
- | | |
|--------------------------------|-----------------------------|
| Neuheit (N) | Ja: Ansprüche 1-10,13,15-17 |
| | Nein: Ansprüche 11-12,14 |
| Erfinderische Tätigkeit (IS) | Ja: Ansprüche 1-10,13,15-17 |
| | Nein: Ansprüche 11-12,14 |
| Gewerbliche Anwendbarkeit (IA) | Ja: Ansprüche: 1-17 |
| | Nein: Ansprüche: |

2. Unterlagen und Erklärungen:

siehe Beiblatt

Zu Punkt IV

Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung

Diese internationale Anmeldung enthält mehrere Erfindungen, nämlich:

1. Ansprüche: 1-10, 17

Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I), Zwischenprodukte der Formel (VIII) und deren Herstellung

2. Ansprüche: 11-16

Verfahren zur Herstellung der Zwischenprodukte (II) sowie die Zwischenprodukte der Formel (IIa), welche eine Untergruppe der Verbindungen (II) sind.

Ein Satz von Ansprüchen ist dann einheitlich, wenn diese durch ein gemeinsames technisches Merkmal verbunden sind, das einen Beitrag zum Stand der Technik darstellt.

Im vorliegenden Fall ist das den Ansprüchen 1-10 einerseits und 11-16 andererseits gemeinsame technische Merkmal die Verbindungen (II) bzw. (IIa), wobei lediglich letztere als Produkte beansprucht werden.

Die Recherche ergab bereits in ihrer Anfangsphase, dass zumindest die Verbindung (IIa), in der Hal1 und Hal2 Chlor bezeichnen und X* für Brom steht, im Stand der Technik bekannt (vgl. Blanchard et al., Am. Chem. J. 30 (1903), 508; im Internationalen Recherchenbericht aufgeführt) und damit die Bedingung der Einheitlichkeit nicht erfüllt ist und somit die Ansprüche 1-10 einerseits und 11-16 andererseits als zwei getrennte Erfindungen angesehen werden müssen.

Darüber hinaus ist eine aus neuen niedermolekularen Endprodukten sowie einigen Gruppen neuer niedermolekularer Zwischenprodukte bestehende Erfindung nur dann einheitlich, wenn die mit der Zielrichtung auf die Endprodukte bereitgestellten Zwischenproduktgruppen durch Einbau eines wesentlichen Strukturelements mit diesem in engem technischen Zusammenhang stehen.

Abgesehen davon, dass im vorliegenden Fall weder die Endprodukte noch die Zwischenverbindungen neu sind, sind die Zwischenverbindungen (II) bzw. (IIa) strukturell derart von den Endprodukten (I) verschieden, dass ein technischer Zusammenhang nicht erkennbar ist.

Erfindung 1 - Ansprüche 1-10,17

Zu Punkt V

Begründete Feststellung nach Regel 66.2(a)(ii) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

- D1: DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN Beilstein Institut zur Förderung der Chemischen Wissenschaften, Frankfurt am Main, DE; XP002253556
D2: WO 92/13845 A (HOECHST AG) 20. August 1992 (1992-08-20)
D3: EP-A-0 378 082 (BASF AG) 18. Juli 1990 (1990-07-18)
D6: DE 199 46 341 A (AVENTIS CROPSOURCE GMBH) 5. April 2001 (2001-04-05)

Die vorliegende Anmeldung offenbart zwei verschiedene Verfahren zur Herstellung der bekannten Verbindungen (I) (Ansprüche 1-8, 17), in dem Verfahren gemäß Ansprüche 1-8 erhaltene Zwischenprodukte der Formel (VIII) sowie deren Herstellung (Ansprüche 9-10), ein Verfahren zur Herstellung der Verbindungen (II) (Ansprüche 11-14) sowie die Verbindungen (IIa) als Untergruppe der Verbindungen (II) (Ansprüche 15-16).

Das anmeldungsgemäße Verfahren zur Herstellung der Verbindungen (I) läßt sich in die folgenden Reaktionsschritte untergliedern:

- i) Umsetzung einer Verbindung (II) mit einer Verbindung der Formel R-Q-H zu (III)
- ii) Ammonolyse einer Verbindung (III), wobei (IV) erhalten wird
- iii) a. Umsetzung von (IV) mit a. einem Cyanat zum Phenylsulfonylisocyanat der Formel (V) oder
b. direkte Umsetzung von (III) mit einem Cyanat zum Isocyanat der Formel (V) oder einem solvatisierten Derivat von (V)
- iv) Reaktion von (V) mit (VI) zu (I)

Stellungnahme zu den Ansprüchen 1-8 und 10:

Verbindungen der allgemeinen Formel (I) und deren Herstellung sind in D2 beschrieben. Hierin wird - analog zum anmeldungsgemäßen Verfahren - eine Verbindung der Formel (III) zu (IV) und nachfolgend zu (V) umgesetzt, wobei in letzterem Reaktionsschritt Phosgen (Variante b. des anmeldungsgemäßen Verfahrens) eingesetzt wird (cf. Bsp. 6, 11 von D2).

Des weiteren ist in D2 die Umsetzung von (V) mit (VI) zu (I) beansprucht, jedoch nicht beispielhaft belegt. Diese Umsetzung, d.h. der Verfahrensschritt (iv) des anmeldungsgemäßen Verfahrens kann beispielsweise dem Dokument D3 (vgl. Kapitel 4.1) entnommen werden.

Als Ausgangsstoffe dienen im Verfahren gemäß D2 Verbindungen der allgemeinen Formel (III); deren Herstellung ist in D2 nicht beschrieben, jedoch verweist D2 in der Beschreibung (Seite 7, letzter Absatz) auf eine Methode zu deren Herstellung, die von der anmeldungsgemäßen völlig verschieden ist.

Bei Schritt i) des anmeldungsgemäßen Verfahrens handelt es sich um eine Umsetzung, die beispielsweise aus D1 bekannt ist.

Der Gegenstand der Ansprüche 1-8 ist daher neu im Sinne des Artikels 33(2) PCT.

Es wird in der vorliegenden Anmeldung eine Zwischenverbindung (VIII) beansprucht, die nicht isoliert wurde, aber deren Abwesenheit gemäß Beschreibung durch die Verschiebung einer Bande im IR-Spektrum nachgewiesen wurde.

Die Verbindung (VIII) ist im Stand der Technik nicht bekannt; der Gegenstand der Ansprüche 9-10 muss daher als neu angesehen werden (Artikel 33(2) PCT).

Die Aufgabe der vorliegenden Anmeldung bestand darin, ein alternatives Verfahren zur Herstellung der bekannten Verbindungen (I) bereitzustellen.

Die Aufgabe wurde gelöst, wie aus der Beschreibung hervorgeht.

Wie bereits oben ausgeführt, müßte der Fachmann, um zum anmeldungsgemäßen Verfahren zu gelangen, nicht weniger als drei verschiedene Dokumente aus dem Stand der Technik miteinander kombinieren.

Da dies nicht als naheliegend angesehen werden kann, läßt sich für den Gegenstand der Ansprüche 1-8 und somit auch für den Gegenstand der Ansprüche 9-10 eine erfinderische Tätigkeit im Sinne des Artikels 33(3) PCT anerkennen.

Sellungnahme zu Anspruch 17:

Ein Verfahren zur Herstellung der anmeldungsgemäßen Verbindungen (I) ist aus D6 bekannt (Anspruch 1); hierin wird ein Sulfonylhalogenid (II), welches den anmeldungsgemäßen Verbindungen (III) entspricht, mit Ammoniak zur einem Sulfonamid (III) um-

gesetzt (vgl. D6, Bsp. 1-4), welches dann mit Phosgen zum Isocyanat (IV) (entsprechend der anmeldungsgemäßen Verbindung (V)) reagiert wird (vgl. D6, Bsp. 5-6); es folgt die dem anmeldungsgemäßen Verfahren völlig analoge Kupplung des Isocyanats mit einem Aminoheterocyclus (V) (entsprechend der anmeldungsgemäßen Verbindung (VI)) zu den Endprodukten (I) (Vgl. D6, Bsp. 7).

Ein alternatives Verfahren zur Herstellung der Verbindungen (I) ist aus D2 bekannt. Hierbei wird ebenfalls zunächst das Sulfonylchlorid ammonolysiert und anschließend mit einem Isocyanat zum Sulfonylharnstoff umgesetzt, welcher dann mit Phosgen zum Sulfonylisocyanat reagiert (D2, Beispiele, Ansprüche)

Somit ist die direkte Umsetzung des Sulfonylchlorids zum Sulfonylisocyanat, wie im anmeldungsgemäßen Verfahren offenbart, als das technische Merkmal anzusehen, das dieses vom Stand der Technik abgrenzt.

Der Gegenstand des Anspruchs 17 ist somit neu im Sinne des Artikels 33(2) PCT.

Nächster Stand der Technik ist D6.

Aufgabe der vorliegenden Anmeldung war es, ein verbessertes Verfahren zur Herstellung der Verbindungen (I) bereitzustellen.

Die Aufgabe wurde dadurch gelöst, daß die ersten beiden Schritte des Verfahrens gemäß D6 zusammengelegt wurden; d.h. anstelle einer Ammonolyse, gefolgt von der Reaktion mit Phosgen wurde das Sulfonylchlorid direkt zum Isocyanat umgesetzt. Ein Isocyanat als Reaktant in einem vergleichbaren Verfahren ist zwar aus D2 bekannt, doch ist auch hier die Ammonolyse ein unumgänglicher Verfahrensschritt.

Das der Anmeldung zugrunde liegende Problem wurde somit auf eine Weise gelöst, die für den Fachmann nicht naheliegend ist.

Für den Gegenstand des Anspruchs 17 läßt sich daher eine erfinderische Tätigkeit im Sinne des Artikels 33(3) PCT anerkennen.

Darüber hinaus wird die folgende Beanstandung erhoben:

Im Widerspruch zu den Erfordernissen der Regel 5.1 a) ii) PCT werden in der Beschreibung weder der in den Dokumenten D1-D3 und D6 offenbarte einschlägige Stand der

Technik noch diese Dokumente angegeben.

Erfindung 2 - Ansprüche 11-16

Zu Punkt V

Begründete Feststellung nach Regel 66.2(a)(ii) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

D5: DE 26 16 612 A (IHARA CHEMICAL IND CO) 13. Januar 1977 (1977-01-13)

Die vorliegende Anmeldung offenbart zwei verschiedene Verfahren zur Herstellung der bekannten Verbindungen (I) (Ansprüche 1-8, 17), in dem Verfahren gemäß Ansprüche 1-8 erhaltene Zwischenprodukte der Formel (VIII) sowie deren Herstellung (Ansprüche 9-10), ein Verfahren zur Herstellung der Verbindungen (II) (Ansprüche 11-14) sowie die Verbindungen (IIa) als Untergruppe der Verbindungen (II) (Ansprüche 15-16).

D5 betrifft die Herstellung von Chlorbenzoylsulfonylchlorid, das unter anderem als eine wichtige Zwischenstufe zur Herstellung von Agrochemikalien bezeichnet wird (D5, Seite 1, erster Absatz). Unter "Chlorbenzoylsulfonylchlorid" werden auch entsprechend substituierte Verbindungen verstanden (vgl. Strukturformel (II) gemäß D5); der Bereich der allgemeinen Formel (II) gemäß D5 überlappt weitgehend mit dem der anmeldungsge-
mäßigen Verbindungen (II).

Gemäß D5 werden die darin offenbarten Chlorbenzoylsulfonylchloride durch gleichzeitige Chlorierung der Sulfonyl- und der Carboxylgruppe der Ausgangsverbindungen erhalten (D5, Seiten 3-5).

Als Chlorierungsmittel wird eine Mischung von Phosgen und Dimethylformamid verwendet.

Darüber hinaus weist D5 auf Seite 1 der Beschreibung auf ein im Stand der Technik bekanntes Verfahren hin, in dem Chlorbenzoylsulfonylchlorid durch Umsetzung eines Alkalimetall- bzw. Ammoniumsalzes einer aromatischen Sulfocarbonsäure mit Phosphorpentachlorid bzw. einer Mischung von Phosphorpentachlorid und Phosphoroxychlorid erhalten wird. Auf Seite 2 der Beschreibung werden die Nachteile dieses literaturbekannten Verfahrens dargelegt.

Diesem Bericht sind zwei der in D5 erwähnten Dokumente beigelegt. Es handelt sich um die folgenden Artikel:

D6: Blanchard; American Chemical Journal 30 (1893), 485-517

D7: Stubbs; American Chemical Journal 50 (1913), 193-204

Sowohl in D6 (S. 487-488) als auch in D7 (S. 196-197) wird beschrieben, wie Vertreter der anmeldungsgemässen Verbindungen (II) durch Reaktion einer entsprechend substituierten aromatischen Sulfocarbonsäure mit Phosphorpentachlorid hergestellt werden.

Somit ist der Gegenstand der Ansprüche 11-12 und 14 durch die Lehre von D6 und D7 neuheitsschädlich getroffen (Artikel 33(2) PCT).

Die Neuheit der anmeldungsgemässen Ansprüche 13 und 15-16 wird anerkannt (Artikel 33(2) PCT).

Als nächster Stand der Technik sind D6 und D7 gleichermassen anzusehen.

In den literaturbekannten Verfahren wird die aromatische Sulfocarbonsäure direkt mit einem Überschuss an Phosphorpentachlorid umgesetzt, wohingegen das Verfahren gemäss Anspruch 13 der vorliegenden Anmeldung in einem inerten Lösemittel unter Einsatz sterisch gehinderter Aminbasen als Katalysator durchgeführt wird.

Da die Zugabe sterisch gehinderter Aminbasen in D6 und D7 weder offenbart noch in irgendeiner Weise vorgeschlagen wird, ist das Verfahren gemäss Anspruch 13 der vorliegenden Anmeldung nicht als naheliegend anzusehen.

Der anmeldungsgemäße Ansprüche 13 erfüllt somit die Erfordernis des Artikels 33(3) PCT.

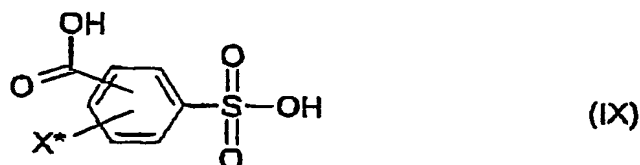
Wesentliche Zwischenprodukte eines erfinderischen Gesamtverfahrens sind ebenfalls als erfinderisch anzusehen; somit genügt der Gegenstand der Ansprüche 15 und 16 ebenfalls der Erfordernis des Artikels 33(3) PCT.

Formale Beanstandungen / Anmerkungen:

Im Widerspruch zu den Erfordernissen der Regel 5.1 a) ii) PCT werden in der Beschreibung weder der in den Dokumenten D6-D7 offenbarte einschlägige Stand der Technik

noch diese Dokumente angegeben.

Es wird angemerkt, dass - um unverhältnismässig hohe Gebühren zu vermeiden - in einem eventuellen europäischen Verfahren beide Erfindungen gemeinsam geprüft werden.



worin X^* wie in Formel (II) definiert ist,

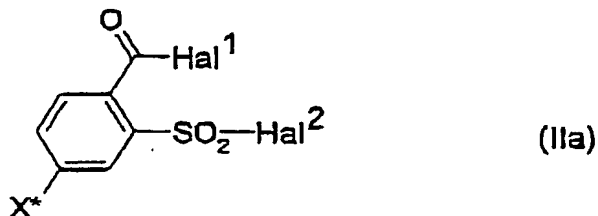
mit einem oder mehreren Halogenierungsmitteln aus der Gruppe der anorganischen Säurehalogenide des Schwefels oder Phosphors in einer oder mehreren Reaktionsschritten zur Verbindung der Formel (II) umsetzt.

12. Verfahren nach Anspruch 11, dadurch gekennzeichnet, dass als Halogenierungsmittel Thionylfluorid, Thionylchlorid, Sulfurylchlorid, Phosphortrichlorid, Phosphorylchlorid, Phosphorpentachlorid oder Phosphortribromid eingesetzt wird.

13. Verfahren nach Anspruch 11 oder 12, dadurch gekennzeichnet, dass es in Gegenwart eines inerten organischen Lösungsmittels und eines Katalysators aus der Gruppe der sterisch gehinderten Aminbasen durchgeführt wird.

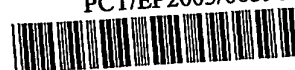
14. Verfahren nach einem der Ansprüche 11 bis 13, dadurch gekennzeichnet, dass die Reaktionstemperatur im Bereich von 20 °C bis 150 °C liegt.

15. Verbindungen der Formel (IIa),



worin Hal^1 , Hal^2 unabhängig voneinander jeweils ein Halogenatom bedeuten und X^* ein Iodatom bedeutet.

16. Verbindungen nach Anspruch 15, dadurch gekennzeichnet, dass Hal^1 und



Translation

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference 2002/M 208	FOR FURTHER ACTION See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)	
International application No. PCT/EP2003/003980	International filing date (day/month/year) 16 April 2003 (16.04.2003)	Priority date (day/month/year) 26 April 2002 (26.04.2002)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07D 251/42, C07C 311/16, A01N 43/66		
Applicant BAYER CROPSCIENCE GMBH		

1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.
2. This REPORT consists of a total of 10 sheets, including this cover sheet.
- ☒ This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).
- These annexes consist of a total of 1 sheets.

3. This report contains indications relating to the following items:

- I ☒ Basis of the report
- II ☐ Priority
- III ☐ Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
- IV ☒ Lack of unity of invention
- V ☒ Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
- VI ☐ Certain documents cited
- VII ☐ Certain defects in the international application
- VIII ☐ Certain observations on the international application

Date of submission of the demand 05 November 2003 (05.11.2003)	Date of completion of this report 21 September 2004 (21.09.2004)
Name and mailing address of the IPEA/EP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP2003/003980

I. Basis of the report

1. With regard to the elements of the international application:*

- ☐ the international application as originally filed
- ☒ the description:
pages 1-27, as originally filed
pages _____, filed with the demand
pages _____, filed with the letter of _____
- ☒ the claims:
pages 1-10, 11(partly), 16(partly), 17, as originally filed
pages _____, as amended (together with any statement under Article 19
pages _____, filed with the demand
pages 11(partly), 12-15, 16 (partly), filed with the letter of 27 August 2004 (27.08.2004)
- ☐ the drawings:
pages _____, as originally filed
pages _____, filed with the demand
pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the sequence listing part of the description:
pages _____, as originally filed
pages _____, filed with the demand
pages _____, filed with the letter of _____

2. With regard to the language, all the elements marked above were available or furnished to this Authority in the language in which the international application was filed, unless otherwise indicated under this item.

These elements were available or furnished to this Authority in the following language _____ which is:

- ☐ the language of a translation furnished for the purposes of international search (under Rule 23.1(b)).
- ☐ the language of publication of the international application (under Rule 48.3(b)).
- ☐ the language of the translation furnished for the purposes of international preliminary examination (under Rule 55.2 and/or 55.3).

3. With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application, the international preliminary examination was carried out on the basis of the sequence listing:

- ☐ contained in the international application in written form.
- ☐ filed together with the international application in computer readable form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in written form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in computer readable form.
- ☐ The statement that the subsequently furnished written sequence listing does not go beyond the disclosure in the international application as filed has been furnished.
- ☐ The statement that the information recorded in computer readable form is identical to the written sequence listing has been furnished.

4. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages _____
- ☐ the claims, Nos. _____
- ☐ the drawings, sheets/fig _____

5. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).**

* Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report since they do not contain amendments (Rule 70.16 and 70.17).

** Any replacement sheet containing such amendments must be referred to under item 1 and annexed to this report.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP2003/003980

IV. Lack of unity of invention

1. In response to the invitation to restrict or pay additional fees the applicant has:

- ☐ restricted the claims.
- ☒ paid additional fees.
- ☐ paid additional fees under protest.
- ☐ neither restricted nor paid additional fees.

2. ☐ This Authority found that the requirement of unity of invention is not complied with and chose, according to Rule 68.1, not to invite the applicant to restrict or pay additional fees.

3. This Authority considers that the requirement of unity of invention in accordance with Rules 13.1, 13.2 and 13.3 is

- ☐ complied with.
- ☐ not complied with for the following reasons:

4. Consequently, the following parts of the international application were the subject of international preliminary examination in establishing this report:

- ☒ all parts.
- ☐ the parts relating to claims Nos. _____

Supplemental Box

(To be used when the space in any of the preceding boxes is not sufficient)

Continuation of: IV

Lack of unity of the invention

This international application contains multiple inventions, as follows:

1. Claims 1-10, 17

Process for the production of compounds of the general formula (I), intermediates of formula (VIII) and production thereof

2. Claims 11-16

Process for the production of intermediates (II) and the intermediates of formula (IIa), which are a sub-group of compounds (II).

A set of claims meets the unity of invention requirement if the claims are linked by a common technical feature representing a contribution over the prior art.

In the present case, the technical feature common to claims 1-10 and 11-16 consists in the compounds (II) and (IIa), only the latter being claimed as products.

Even in its initial stages, the search revealed that at least the compound (IIa) wherein Hal1 and Hal2 are chlorine and X* represents bromine is known in the prior art (cf. Blanchard et al., Am. Chem. J. 30 (1903), 508; cited in the international search report). The unity of invention requirement is not therefore satisfied, and

Supplemental Box

(To be used when the space in any of the preceding boxes is not sufficient)

Continuation of: IV

claims 1-10 and 11-16 must thus be regarded as two separate inventions.

Furthermore, an invention consisting of novel low molecular weight end products and some groups of novel low molecular weight intermediates meets the unity of invention requirement only if the groups of intermediates prepared with the objective of producing the end products are, as a result of the incorporation of an essential structural element, in a close technical relationship therewith.

Apart from the fact that, in the present case, neither the end products nor the intermediate compounds are novel, the intermediate compounds (II) and (IIa) are structurally so different from the end products (I) that there is no discernible technical relationship.

V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement**1. Statement**

Novelty (N)	Claims	1-10, 13, 15-17	YES
	Claims	11-12, 14	NO
Inventive step (IS)	Claims	1-10, 13, 15-17	YES
	Claims	11-12, 14	NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-17	YES
	Claims		NO

2. Citations and explanations**Invention 1 - Claims 1-10, 17**

D1: DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN Beilstein Institut zur Förderung der Chemischen Wissenschaften, Frankfurt am Main, DE; XP002253556

D2: WO 92/13845 A (HOECHST AG) 20 August 1992 (1992-08-20)

D3: EP-A-0 378 082 (BASF AG) 18 July 1990 (1990-07-18)

D6: DE 199 46 341 A (AVENTIS CROPS SCIENCE GMBH) 5 April 2001 (2001-04-05)

The present application discloses two different processes for the production of the known compounds (I) (claims 1-8, 17), intermediates of formula (VIII) obtained in the process defined in claims 1-8 and production thereof (claims 9-10), a process for the production of compounds (II) (claims 11-14), and compounds (IIa) as sub-group of compounds (II) (claims 15-16).

The claimed process for the production of compounds (I) can be subdivided into the following reaction steps:

- (i) reaction of a compound (II) with a compound of the formula R-Q-H to form (III)

- (ii) ammonolysis of a compound (III), resulting in compound (IV)
- (iii) (a) reaction of (IV) with a cyanate to form the phenylsulphonyl isocyanate of formula (V) or
(b) direct reaction of (III) with a cyanate to form the isocyanate of formula (V) or a solvated derivative of (V)
- (iv) reaction of (V) with (VI) to form (I)

Observations on claims 1-8 and 10:

Compounds of the general formula (I) and the production thereof are described in D2. There, in a manner similar to the process defined in the application, a compound of formula (III) is reacted to form (IV) and subsequently (V), phosgene (variant (b) of the process defined in the application) being used in the latter reaction step (cf. examples 6 and 11 of D2).

Furthermore, in D2 the reaction of (V) with (VI) to form (I) is claimed but is not supported by examples. This reaction, i.e. process step (iv) of the process defined in the application, is described in D3, for example (cf. section 4.1).

The reactants used in the D2 process are compounds of the general formula (III); their production is not described in D2, but the D2 description (page 7, last paragraph) refers to a method for their production that is totally different from that defined in the application.

Step (i) of the process defined in the application is a reaction known from D1, for example.

The subject matter of claims 1-8 is therefore novel (PCT Article 33(2)).

The present application claims an intermediate compound (VIII) which was not isolated but the absence of which was detected by displacement of a band in the IR spectrum, according to the description.

Compound (VIII) is not known in the prior art; the subject matter of claims 9-10 must therefore be regarded as novel (PCT Article 33(2)).

The problem addressed by the present invention is to provide an alternative process for the production of the known compounds (I).

The problem was solved, as is clear from the description.

As already stated above, a person skilled in the art would have to combine at least three different prior art documents to arrive at the process defined in the application.

Since this cannot be regarded as obvious, an inventive step (PCT Article 33(3)) is acknowledged for the subject matter of claims 1-8 and therefore also for the subject matter of claims 9-10.

Observations on claim 17:

A process for the production of compounds (I) as defined in the application is known from D6 (claim 1). In this citation a sulphonyl halide (II) corresponding to compounds (III) as defined in the application is reacted with ammonia to form a sulphonamide (III) (cf. D6,

examples 1-4). The sulphonamide is then reacted with phosgene to form the isocyanate (IV) (corresponding to compound (V) as defined in the application) (cf. D6, examples 5-6). The isocyanate is then coupled, in a manner entirely similar to the process defined in the application, with an aminoheterocycle (V) (corresponding to compound (VI) as defined in the application) to form the end products (I) (cf. D6, example 7).

An alternative process for the production of the compounds (I) is known from D2. In that process the sulphonyl chloride is likewise initially ammonolysed and then reacted with an isocyanate to form sulphonylurea, which then reacts with phosgene to form the sulphonyl isocyanate (D2, examples, claims).

The direct conversion of the sulphonyl chloride into the sulphonyl isocyanate, as disclosed in the process defined in the application, must therefore be considered to be the technical feature delimiting said process over the prior art.

The subject matter of claim 17 is therefore novel (PCT Article 33(2)).

Closest prior art is D6.

The problem addressed by the present application is to provide an improved process for the production of compounds (I).

The problem was solved by amalgamating the first two steps of the D6 process; in other words, instead of ammonolysis followed by the reaction with phosgene, the sulphonyl chloride was converted directly into the isocyanate.

Although an isocyanate is already known from D2 as reactant in a similar process, there too ammonolysis is a necessary process step.

The problem addressed by the application is therefore solved in a manner not obvious to a person skilled in the art.

An inventive step (PCT Article 33(3)) can therefore be acknowledged for the subject matter of claim 17.

The following objection is also raised:

Contrary to the requirements of PCT Rule 5.1(a)(ii) neither the relevant prior art disclosed in documents D1-D3 and D6 nor these documents have been indicated in the description.

Invention 2 - Claims 11-16

D5: DE 26 16 612 A (IHARA CHEMICAL IND CO) 13 January 1977 (1977-01-13)

The present application discloses two different processes for the production of the known compounds (I) (claims 1-8, 17), intermediates of formula (VIII) obtained in the process defined in claims 1-8 and production thereof (claims 9-10), a process for the production of compounds (II) (claims 11-14), and compounds (IIa) as subgroup of compounds (II) (claims 15-16).

D5 relates to the production of chlorobenzoyl sulphonyl chloride, which is said to be *inter alia* a major intermediate for the production of agrochemicals (D5,

page 1, first paragraph). The term "chlorobenzoyl sulphonyl chloride" is also understood to cover appropriately substituted compounds (cf. structural formula (II) as per D5); the range of compounds covered by the general formula (II) as per D5 overlaps to a large extent with that of compounds (II) as defined in the application.

According to D5, the chlorobenzoyl sulphonyl chlorides disclosed therein are obtained by simultaneous chlorination of the sulphonyl group and carbonyl group of the starting compounds (D5, pages 3-5).

A mixture of phosgene and dimethyl formamide is used as chlorinating agent.

On page 1 of the description, D5 also refers to a process known in the prior art wherein chlorobenzoyl sulphonyl chloride is obtained by reacting an alkali metal salt or ammonium salt of an aromatic sulphocarboxylic acid with phosphorus pentachloride or a mixture of phosphorus pentachloride and phosphoryl chloride. Page 2 of the description explains the disadvantages of this process which is known from the literature.

Two of the documents mentioned in D5 are attached to this report. The documents concerned are the following articles:

D6: Blanchard, American Chemical Journal 30 (1903),
485-517

D7: Stubbs, American Chemical Journal 50 (1913),
193-204

Both D6 (pages 487-488) and D7 (pages 196-197) describe how representatives of compounds (II) as defined in the

application are produced by reacting an appropriately substituted aromatic sulphocarboxylic acid with phosphorus pentachloride.

The subject matter of claims 11-12 and 14 is therefore anticipated by the teaching of D6 and D7 in a manner prejudicial to novelty (PCT Article 33(2)).

The novelty of claims 13 and 15-16 is acknowledged (PCT Article 33(2)).

Both D6 and D7 are considered to be the closest prior art.

In the processes known from the literature the aromatic sulphocarboxylic acid is reacted directly with an excess of phosphorus pentachloride. By contrast, the process defined in claim 13 of the present application is carried out in an inert solvent using sterically hindered amine bases as catalyst.

Since the addition of sterically hindered amine bases is neither disclosed nor in any way proposed in D6 and D7, the process defined in claim 13 of the present application can be considered non-obvious.

Claim 13 of the application therefore satisfies the requirement of PCT Article 33(3).

Essential intermediates forming part of a whole process acknowledged as inventive are likewise to be regarded as inventive. The subject matter of claims 15 and 16 therefore likewise satisfies the requirement of PCT Article 33(3).

Formal objections / observations:

Contrary to the requirements of PCT Rule 5.1(a)(ii) neither the relevant prior art disclosed in documents D6-D7 nor these documents have been indicated in the description.

It should be noted that, to avoid inordinately high fees, the two inventions will be examined together in any European procedure.